

Antiperspirants contg. aescigenin, aesculetin - hesperitin, sitosterols, glycyrrhetic acid or derivs. or sage oil

Patent Number : **DE2523866**

International patents classification : A61K-007/32

• **Abstract :**

DE2523866 A Antiperspirant compsns. contain one or more of the following active ingredients: (a) aescigenin or a glycoside, salt or ester thereof (esp. aescin or its Na, K or NH₄ salt); (b) aesculetin or glycoside thereof (esp. aesculin); (c) hesperitin or a glycoside, chalcone deriv. or ester thereof (esp. hesperidin or a chalcone deriv. or phosphate-ester salt thereof); (d) a sitosterol (esp. beta-sitosterol); (e) glycyrrhetic acid or a salt, ester or a 3-glucuronyl deriv. thereof (esp. glycyrrhizinic acid or its Na, K or NH₄ salt); and (f) sage oil. The active ingredients give an excellent antiperspirant effect at low concns. (e.g. 0.2-1.0 wt.%) without the side-effects associated with known antiperspirants.

• **Publication data :**

Patent Family : DE2523866 A 19761201 DW1976-50 *
JP52105221 A 19770903 DW1977-41
FR2345143 A 19771125 DW1978-03
DE2523866 B 19780209 DW1978-07

GB1509837 A 19780504 DW1978-18

JP85030287 B 19850716 DW1985-32

Priority n° : 1975DE-2523866 19750530

Covered countries : 4

Publications count : 6

• **Patentee & Inventor(s) :**

Patent assignee : (GREV/) GREVE R

• **Accession codes :**

Accession N° : 1976-92761X [50]

• **Derwent codes :**

Manual code : CPI: B01-D02 B04-A07E
B04-B01C B06-A01 B07-A02 B12-L01
D08-B09

Derwent Classes : B05 D21

• **Update codes :**

Basic update code : 1976-50
Equiv. update code : 1977-41; 1978-03;
1978-07; 1978-18; 1985-32

THIS PAGE BLANK (USPTO)

51

Int. Cl. 2:

A 61 K 7/32

19 BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

DEUTSCHES PATENTAMT



DT 25 23 866 A 1

11

Offenlegungsschrift 25 23 866

21

Aktenzeichen:

P 25 23 866.8-41

22

Anmeldetag:

30. 5. 75

43

Offenlegungstag:

2. 12. 76

30

Unionspriorität:

32 33 31

54

Bezeichnung:

Schweißhemmendes Mittel

71

Anmelder:

Greve, Rainer, Dr., 2360 Bad Segeberg

72

Erfinder:

gleich Anmelder

Prüfungsantrag gem. § 28 b PatG ist gestellt

DT 25 23 866 A 1

Aktenzeichen: Neuanmeldung
Anmelder: Dr. Rainer Greve

Schweißhemmendes Mittel

Die Erfindung betrifft ein schweißhemmendes Mittel zur äußerlichen Anwendung in Form einer festen oder flüssigen Mischung mit einem Gehalt an mindestens einem Wirkstoff und bekannten unschädlichen Hilfs- oder Trägerstoffen.

Die bekannten schweißhemmenden Mittel dieser Art enthalten als Wirkstoff üblicherweise Metallsalze wie Aluminiumchlorid-hydrat oder Zinkphosphat, die zwar eine zufriedenstellende schweißhemmende Wirkung zeigen, jedoch wegen verschiedener Nebenwirkungen, insbesondere der bei Sprays auftretenden Gefahr unbeabsichtigten Inhalierens bedenklich erscheinen. Dies gilt um so mehr, als die bisher als Wirkstoffe verwendeten Metallsalze zur Erzielung einer ausreichenden Schweißhemmung in relativ hoher Konzentration eingesetzt werden müssen.

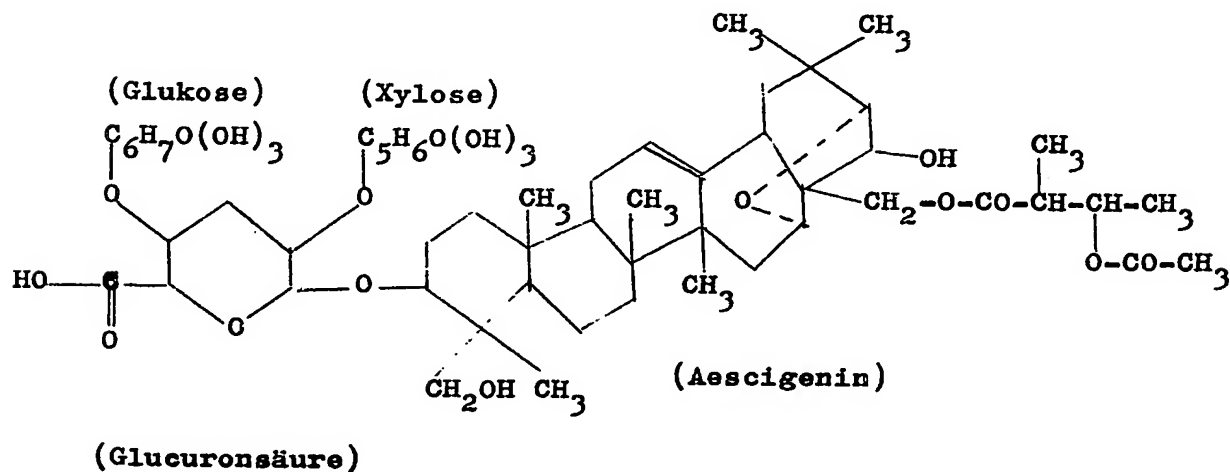
Aufgabe der Erfindung ist es nun, ein schweißhemmendes Mittel der eingangs genannten Art zu schaffen, das die bisherigen Nachteile vermeidet und bei einfacher, unaufwendiger Herstellung ohne Verwendung physiologisch bedenklicher Metallsalze eine ausgezeichnete schweißhemmende Wirkung besitzt.

Zur Lösung dieser Aufgabe ist das schweißhemmende Mittel der eingangs genannten Art erfindungsgemäß gekennzeichnet durch einen wirksamen Gehalt an mindestens einem der Wirkstoffe:

- a) Aescigenin und dessen physiologisch unbedenklichen Glykosiden, Salzen oder Estern, insbesondere Aescin und dessen Natrium-, Kalium- oder Ammoniumsalz,
- b) Aesculetin und dessen physiologisch unbedenklichen Glykosiden, insbesondere Aesculin,
- c) Hesperitin und dessen physiologisch unbedenklichen Glykosiden, Chalconderivaten und Estern, insbesondere Hesperidin und dessen Chalconderivaten oder Phosphorsäureester-salzen,
- d) Sitosterin, insbesondere β -Sitosterin,
- e) Glycyrrhetinsäure und deren physiologisch unbedenkliche Salze, Ester und 3-Glucuronderivate, insbesondere Glycyrrhizinsäure und deren Natrium-, Kalium- oder Ammoniumsalze und
- f) Salbeiöl.

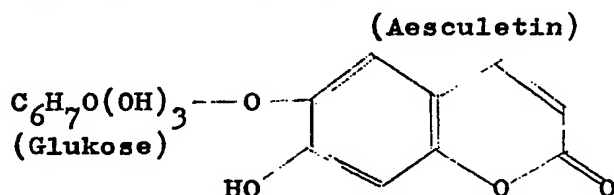
Bevorzugte Ausführungsformen des schweißhemmenden Mittels sind in den Unteransprüchen beschrieben.

Das zur Verwendung in den erfindungsgemäßen schweißhemmenden Mitteln geeignete Aescin ist ein saures Triterpönglykosid der allgemeinen Formel:



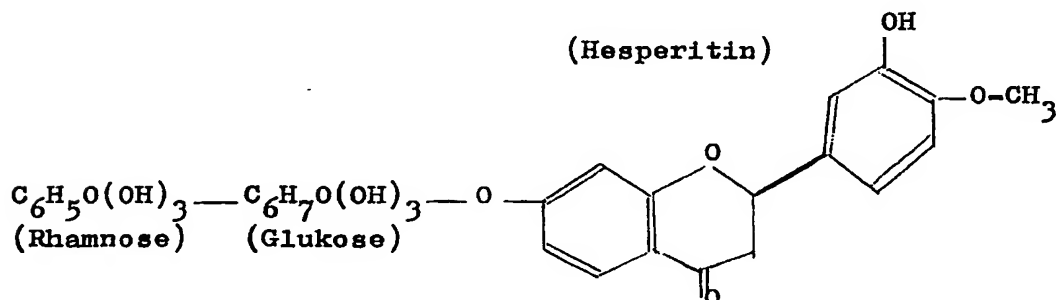
Anstelle des Aescins können in dem erfindungsgemäßen schweißhemmenden Mitteln auch das diesem zugrundeliegende Aglukon Aescigenin oder andere physiologisch unbedenkliche Glykoside, Salze oder Ester desselben Verwendung finden.

Das Aesculin entspricht der Formel:



Anstelle des Aesculins können auch dessen Bestandteil Aesculetin und andere physiologisch unbedenkliche Glykoside desselben eingesetzt werden.

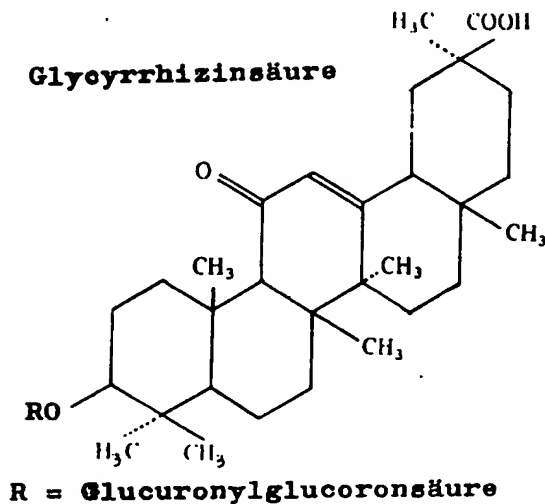
Das Hesperidin entspricht der Formel:



Anstelle des Hesperidins können auch dessen Aglukon Hesperitin sowie andere, physiologisch unbedenkliche Glykoside, Chalconderivate und Ester desselben als Wirkstoff eingesetzt werden.

β -Sitosterin ist ein dem Cholesterin ähnliches Sterin pflanzlicher Herkunft und unterscheidet sich von diesem nur durch eine zusätzliche Äthylgruppe am Kohlenstoffatom 23.

Glycyrrhizinsäure besitzt die Formel:



Glycyrrhizinsäure unterscheidet sich von der Glycyrrhetinsäure nur durch einen Glucuronylglucuronsäurerest am Kohlenstoffatom 3. Anstelle dieser beiden Verbindungen können auch andere physiologisch unbedenkliche Salze und Ester der Glycyrrhetinsäure benutzt werden.

Salbeiöl ist ein aus der Salbeipflanze gewonnenes ätherisches Öl.

Aescopin und dessen Natriumsalz, Aesculin, Hesperidin, β -Sitosterin, Glycyrrhetinsäure, Glycyrrhizinsäure und Salbeiöl sind bekannte, im Handel erhältliche Stoffe, die bisher für verschiedene therapeutische Zwecke eingesetzt wurden und sich jetzt überraschend als schweißhemmende Wirkstoffe geeignet erwiesen haben.

Im folgenden wird die Wirksamkeit der erfindungsgemäßen schweißhemmenden Mittel anhand von Versuchen weiter erläutert.

Zur Durchführung von Vergleichsversuchen wurden schweißhemmende Mittel in Form einer wässrig-alkoholischen Lösung mit

einem Gehalt von 80 Gew.% Isopropylalkohol und 20 Gew.% Wasser und einem Gehalt von jeweils 0,2 Gew.% Aescin, Aesculin bzw. Glycyrrhizinsäure sowie eine 0,2 Gew.% β -Sitosterin enthaltende Lösung in Isopropylalkohol und eine 1% Salbeiöl (Oleum Salviae) in Isopropylalkohol hergestellt. Die so erhaltenen schweißhemmenden Mittel wurden jeweils in Tropfflaschen abgefüllt und an stark zum Schwitzen neigende Probanden ausgegeben, welche jeweils morgens nach dem Waschen zehn Tropfen (= 0,5 ml) unter eine der beiden Achseln auftrugen und über einen Versuchszeitraum von mehreren Wochen die im Vergleich zur anderen Achsel erzielte schweißhemmende Wirkung beurteilten. Zusätzlich zu den Tropfflaschen mit den die erfindungsgemäßen Wirkstoffe enthaltenden Lösungen wurden Tropfflaschen mit wirkstofffreien Lösungen (Placebos) mit ausgegeben, wobei darauf geachtet wurde, daß alle Tropfflaschen ungekennzeichnet und ohne erkennbaren Unterschied verteilt wurden. Die Ergebnisse der Versuche sind in der folgenden Tabelle I zusammengefaßt:

I					
Versuch	Wirkstoff	Anzahl der Probanden	Beurteilung der Wirksamkeit		
			sehr gut oder gut	ausreichend	unzureichend
A	Aescin	70	62	5	3
B	Aesculin	69	59	6	4
C	Glycyrrhizinsäure	32	29	2	1
D	β -Sitosterin	46	43	2	1
E	Salbeiöl	28	25	2	1

In einer zweiten Versuchsreihe wurde mit entsprechenden Lösungen mit einem Wirkstoffgehalt von 0,4 Gew.% gearbeitet. Zum Vergleich wurde ferner noch eine 1,0 Gew.% β -Sitosterin enthaltende Lösung eingesetzt. Die Ergebnisse dieser Versuche sind in der folgenden Tabelle II zusammengestellt.

II

Versuch	Wirkstoff	Konzentration Gew. %	Anzahl der Pro- banden	Beurteilung der Wirksamkeit		
				sehr gut oder gut	ausrei- chend	unzu- reichend
F	β -Sitosterin	0,4	32	30	1	1
G	β -Sitosterin	1,0	34	34	0	0
H	Glycyrrhizin- säure	0,4	13	12	1	0
I	Aescin	0,4	33	30	2	1
K	Aesculin	0,4	22	20	2	0

Die in den Tabellen aufgeführten Ergebnisse zeigen, daß die erfindungsgemäßen schweißhemmenden Mittel ganz überwiegend als gut oder sehr gut wirksam beurteilt wurden. Besonders günstige Ergebnisse wurden bei Verwendung von β -Sitosterin erzielt.

Weitere Versuche haben ergeben, daß schweißhemmende Mittel mit einem kombinierten Gehalt von zwei oder mehreren verschiedenen Wirkstoffen der im Patentanspruch 1 genannten Gruppen a) bis f) zu einer synergistischen Steigerung der schweißhemmenden Wirkung führen.

Die Konzentration der in den erfindungsgemäßen schweißhemmenden Mitteln verwendeten Wirkstoffe soll unter Berücksichtigung der Anwendungsform (Stift, Pulver, Lösung, Suspension, Spray), der Anwendungsweise und der Eigenschaften des Wirkstoffs so innerhalb der angegebenen Mengenbereiche abgestimmt werden, daß sich eine^{den} jeweiligen Anforderungen entsprechende schweißhemmende Wirkung ergibt. Dabei kann die für den Einzelfall optimale Wirkstoffkonzentration erforderlichenfalls leicht durch einige Vorversuche ermittelt werden.

- 7 -

Aktenzeichen: Neuanmeldung
Anmelder: Dr. Rainer Greve

PATENTANSPRÜCHE

- ① Schweißhemmendes Mittel zur äußerlichen Anwendung in Form einer festen oder flüssigen Mischung mit einem Gehalt an mindestens einem Wirkstoff sowie bekannten, unschädlichen Hilfs- und Trägerstoffen, gekennzeichnet durch einen wirksamen Gehalt an mindestens einem der Wirkstoffe:
 - a) Aescigenin und dessen physiologisch unbedenklichen Glykosiden, Salzen oder Estern, insbesondere Aescin und dessen Natrium-, Kalium- oder Ammoniumsalz,
 - b) Aesculetin und dessen physiologisch unbedenklichen Glykosiden, insbesondere Aesculin,
 - c) Hesperitin und dessen physiologisch unbedenklichen Glykosiden, Chalconderivaten und Estern, insbesondere Hesperidin und dessen Chalconderivaten oder Phosphorsäureester-Salzen,
 - d) Sitosterin, insbesondere β -Sitosterin,
 - e) Glycyrrhetinsäure und deren physiologisch unbedenkliche Salze, Ester und 3-Glucuronderivate, insbesondere Glycyrrhizinsäure und deren Natrium-, Kalium- oder Ammoniumsalze und
 - f) Salbeiöl.
- 2) Schweißhemmendes Mittel nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt der einzelnen Wirkstoffe jeweils 0,02 bis 10 Gew.%, vorzugsweise 0,05 bis 2 Gew.%, insbesondere 0,1 bis 1,2 Gew.% beträgt.
- 3) Schweißhemmendes Mittel nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß darin 0,2 bis 1 Gew.%

Aescin oder dessen Na-, K- oder NH_4 -Salz enthalten sind.

- 4) Schweißhemmendes Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß darin 0,2 bis 1 Gew.% Aesculin enthalten ist.
- 5) Schweißhemmendes Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß darin 0,1 bis 5 Gew.%, insbesondere 0,2 bis 2 Gew.% β -Sitosterin enthalten sind.
- 6) Schweißhemmendes Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß darin 0,2 bis 1 Gew.% Glycyrrhizinsäure oder deren Na-, K- oder NH_4 -Salze enthalten sind.
- 7) Schweißhemmendes Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß darin 0,2 bis 5 Gew.%, vorzugsweise 0,5 bis 2 Gew.% Salbeiöl enthalten sind.
- 8) Schweißhemmendes Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, daß darin mindestens 2 jeweils verschiedenen der Gruppen a) bis f) angehörenden Wirkstoffe enthalten sind.
- 9) Schweißhemmendes Mittel nach Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, daß darin 0,2 bis 2 Gew.% β -Sitosterin und jeweils 0,2 bis 1 Gew.% Glycyrrhetinderivat und/oder Aescin enthalten sind.
- 10) Schweißhemmendes Mittel in Sprayform nach einem der Ansprüche 1 bis 9, mit einer überwiegend aus Wasser und/oder unbedenklichen, flüchtigen aliphatischen Alkoholen bestehenden Trägerflüssigkeit, dadurch gekennzeichnet, daß darin 0,1 bis 2 Gew.%, vorzugsweise 0,2 bis 1 Gew.% mindestens eines der Wirkstoffe ge-

2523866

löst oder suspendiert ist.

- 11) Schweißhemmendes Mittel in Stift- oder Pulverform gemäß einem der Ansprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, daß darin neben üblichen Trägerstoffen 0,1 bis 2 Gew.%, vorzugsweise 0,2 bis 1 Gew.% mindestens eines der Wirkstoffe enthalten ist.

609849/0845

ORIGINAL INSPECTED